

环孢素〔基〕 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文  
[https://www.100test.com/kao\\_ti2020/313/2021\\_2022\\_\\_E7\\_8E\\_AF\\_E5\\_AD\\_A2\\_E7\\_B4\\_A0\\_E3\\_c22\\_313983.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/313/2021_2022__E7_8E_AF_E5_AD_A2_E7_B4_A0_E3_c22_313983.htm) 药品名称环孢素〔基〕 药物别名环孢素，环孢菌素A，Cyclosporin A，SANDIMMUN，SANDIMMUNE 英文名称Ciclosporin 类别其他抗肿瘤药及辅助治疗药制剂胶囊剂：每粒25mg；100mg。口服液：每瓶50ml；100ml（10mg/ml）。药理及应用环孢素主要作用于T辅助（Th）细胞和Th细胞产生的细胞因子包括白细胞介素2。由于Th细胞在细胞免疫中具有重要地位，所以服药后病人的细胞免疫功能受到抑制。与其他免疫抑制剂不同，本品对骨髓无明显抑制作用。一般与皮质甾醇类或其他免疫抑制剂并用。本品服后吸收不完全，生物利用度为30%左右。血药浓度高峰在口服后3.5小时。由于进入体内后广泛分布于组织中，41%~58%在红细胞中，10%~20%在白细胞中。其余在血浆中。90%左右与蛋白质结合，主要是脂蛋白。由于主要分布于血细胞中，每服本品1mg血浆中浓度峰值只有1ng/ml（HPLC法），全血峰值1.4~2.7ng/ml。血中清除呈二室模型，终末t<sub>1/2</sub>为10~27小时，儿童较快。主要在肝脏代谢，由胆汁通过粪便排出。只有6%由尿中排出，不足0.1%为原形。本品可透过胎盘和进入乳汁。由于本品进入血细胞的比例受温度影响，在37℃为21℃的两倍。所以使用期间应监测全血的药物浓度。除HPLC外最近多应用特异性单克隆抗体放射免疫法。临床适应证：主要用于器官或组织移植包括骨髓移植。说明本品是一种作用于T淋巴细胞的强力免疫抑制剂。主要用于预防器官或组织移植后的移植物抗宿主（GVH）反应。可以口服也可注射。对很多自家免疫反应性

疾病也有效。用法用量初次用药每日10~15mg/kg，在移植前4~12小时开始，用药1~2周改为维持剂量每日2~6mg/kg。与其他免疫抑制剂并用可适当减量。为了避免长期应用的不良反应，应按期检查肝肾功能和血浓度。有肝肾功能障碍时应调整剂量，全血浓度应维持在250~800ng/ml，血浆50~300ng/ml。肌肉注射剂量为口服的1/3。注重事项本品在静脉注射可有过敏反应，故一般最好口服或肌注。（1）约1/2的病人有一定肾毒性，故应避免和其他具有肾毒性的药物合用。本品的肾毒性与剂量相关，如能监测血药浓度适当降低药量可在一定程度上减轻肾毒性。（2）部分病人可有消化道反应及肝毒性。本品主要由肝脏代谢，所以能诱导肝脏药酶的药物如酮康唑、红霉素、皮质激素、两性霉素及钙离子阻滞剂等能降低本品的血药浓度。（3）中枢神经毒性也较常见，有的病人肢体感觉障碍。少数病人有意识障碍、抽搐可能与低镁血症有关。（4）有的病人可有高血压及电解质紊乱，如高血钾症。（5）有的病人可有面部浮肿、痤疮和牙龈增生。（6）由于长期免疫抑制，病人发生淋巴瘤的机会高于普通人群。100Test 下载频道开通，各类考试题目直接下载。详细请访问 [www.100test.com](http://www.100test.com)